

①③
DEMANDE
DE BREVET D'INVENTION

1^{re} PUBLICATION

②② Date de dépôt..... 29 juin 1970, à 14 h.
④① Date de la mise à la disposition du
public de la demande..... B.O.P.I. — «Listes» n. 8 du 25-2-1972.

⑤① Classification internationale (Int. Cl.)... A 61 k 27/00.

⑦① Déposant : GIRAUX Georges-Louis, résidant en France.

Titulaire : *Idem* ⑦①

⑦④ Mandataire : Armengaud Aîné, 21, boulevard Poissonnière, Paris (2).

⑤④ Nouvelles compositions pour la prévention et le traitement des troubles dus à la photosensibilité de la peau.

⑦② Invention de :

③③ ③② ③① Priorité conventionnelle :

La présente invention a pour objet de nouvelles compositions utilisables localement en tant que topiques, sous forme de crèmes, pommades, suspensions liquides, etc... pour la prévention et le traitement de troubles locaux résultant de la photosensibilité de la peau, notamment pour la prévention et le traitement des érythèmes solaires, de la photosensibilisation due à l'absorption de médicaments, à une modification de l'état général (grossesse par exemple, etc...)

Ces nouvelles compositions sont caractérisées en ce qu'elles sont constituées par l'association d'au moins une vitamine du groupe B, avec au moins un stéroïde possédant une action anti-inflammatoire et anti-allergique, tel qu'un dérivé d'hydrocortisone, par exemple, dans un excipient permettant l'application desdites compositions en tant que topiques.

Suivant un mode de réalisation avantageux de la composition conforme à la présente invention, la vitamine du groupe B est la vitamine B 2 ou riboflavine.

Suivant un autre mode de réalisation avantageux de la composition conforme à la présente invention, la vitamine B2 est associée à une autre vitamine du groupe B, telle que la vitamine PP ou amide nicotinique.

Un exemple non limitatif d'une composition préférée conforme à la présente invention comprend les constituants^{actifs}/suivants :
Vitamines du groupe B : Riboflavine

Amide nicotinique

Stéroïde : 17 - valérate de Bétaméthasone

Excipient propre à permettre l'application locale de la composition en tant que topique.

Les compositions conformes à la présente invention peuvent être utilisées en tant que compositions cosmétiques, notamment pour la protection de la peau vis-à-vis de l'exposition aux rayons solaires et pour l'obtention de la pigmentation dite "bronzage", c'est-à-dire comme crèmes dites "solaires" ; elles peuvent également être utilisées en tant que compositions thérapeutiques pour le traitement de troubles locaux de la peau, tels qu'érythèmes, notamment érythèmes solaires, prurits, troubles dus à une photosensibilisation excessive de la peau, soit naturelle, soit provoquée par des agents exogènes tels qu'absorption de médicaments ayant un effet secondaire photosensibilisant.

Selon que les compositions conformes à la présente invention sont utilisées en tant que compositions cosmétiques ou en tant que compositions thérapeutiques, elles contiennent des doses différentes de constituants actifs. C'est ainsi que la composition conforme à la présente invention mentionnée plus haut à titre d'exemple peut présenter la composition quantitative suivante si elle est utilisée à des fins thérapeutiques:

Vitamines du groupe B : Riboflavine		8,5 à 12 mg
Amide nicotinique		80 à 120 mg
10 Stéroïde	: 17 - valérate de bétaméthasone	150 à 250 mg
Excipient	:	120 à 150 ml
Essence aromatique	:	Q.S.,

ou la composition quantitative suivante si elle est

15 utilisée à des fins cosmétiques :		
Vitamines du groupe B : Riboflavine		4 à 8 mg
Amide nicotinique		40 à 70 mg
Stéroïde	: 17 - valérate de bétaméthasone	80 à 120 mg
20 Excipient	:	120 à 150 ml
Essence aromatique	:	Q.S.

L'on peut utiliser comme excipient, l'un quelconque des excipients connus propres à l'application de la composition conforme à l'invention en tant que topique, et compatibles avec les constituants actifs de la composition.

L'un des excipients préférés est cependant l'huile d'olive vierge première pression dont l'action anti-brûlures est bien connue.

La riboflavine est connue en elle-même pour son action antinévritique, pour son action sur les dermatoses dues à une avitaminose B₂ et pour son action sur les lésions oculaires et buccales dues à une avitaminose B₂.

L'amide nicotinique ou antipellagreuse est connue en elle-même pour son action sur les troubles cutanés, digestifs et nerveux, dus à une avitaminose PP.

Les dérivés de l'hydrocortisone sont connus en eux-mêmes pour leur action anti-inflammatoire et anti-allergique.

La composition conforme à la présente invention qui réunit les constituants actifs précités fait apparaître une synergie d'action : en effet, si l'on élimine le stéroïde de la composition

s'exposer au soleil pendant une heure. Au bout de cette heure, il la ré-examine : disparition totale des sensations de brûlure , atténuation très importante des éléments balleux.

5 Le Demandeur fait réitérer l'expérience à cette patiente les jours suivants, avec exposition au soleil après application de la composition conforme à l'invention : des examens quotidiens lui permettent de constater que l'exposition au soleil n'entraîne plus aucun trouble, que le "bronzage", c'est-à-dire la pigmentation de la peau, est obtenu de façon rapide, homogène
10 et esthétique, sans effets secondaires sur l'état général, ni sur la tension, ni sur le coeur.

2ème observation :

Toute la famille J.E., père, mère et quatre enfants, souffre d'une hypersensibilité aux rayons solaires.

15 Le Demandeur leur fait faire des applications quotidiennes de la composition conforme à la présente invention, avant exposition au soleil: la disparition totale de l'hypersensibilité aux rayons solaires est constatée, avec un brunissement satisfaisant et homogène de la peau, sans aucune réaction sur l'état général.

20 3ème observation :

Madame Nadine G. et ses enfants, qui vivent au Mexique, recourent à des applications quotidiennes de la composition conforme à la présente invention avant exposition aux rayons solaires.

25 Dans ces cas également, une disparition totale de l'hypersensibilité aux rayons solaires est constatée, ainsi qu'un brunissement rapide, esthétique et homogène de la peau.

De plus, des éléments acneiformes présents antérieurement à l'application de la composition conforme à la présente invention, disparaissent également à la suite de l'application de cette dernière.
30

4ème observation :

Essai conduit en "double aveugle" avec application d'eau bi-distillée.

35 Madame A.H., 50 ans, souffre d'un érythème solaire au 3ème degré à la suite d'une exposition aux rayons solaires. Une demi-heure après une application de la composition conforme à la présente invention, ré-exposition aux rayons solaires. Le Demandeur et la patiente constatent la guérison complète de l'érythème, et l'obtention de la pigmentation désirée de la peau, sans réaction
40 générale aucune.

ci-dessus; on constate que la composition incomplète ainsi obtenue n'exerce plus d'action sur le prurit concomittant aux troubles cutanés. Si, au contraire, la composition ne comporte plus de vitamine PP, l'on constate qu'elle n'exerce plus d'activité en tant que crème "solaire" sur la pigmentation de la peau, c'est-à-dire en tant qu'agent bronzant. Si, d'autre part, l'on exclut de la composition la vitamine B₂, l'on constate une diminution importante, ou même la disparition totale, de l'action sur le prurit et sur la photosensibilisation de la peau.

10 Il résulte de l'expérimentation effectuée par le Demandeur afin de mettre en évidence la synergie d'action des constituants des compositions conformes à la présente invention, que la vitamine B₂ exerce sur les autres constituants de la composition une action déterminante dans le sens d'une synergie, en ce que sa présence détermine une activité importante de la composition sur le prurit et sur la photosensibilisation de la peau, activité sans commune mesure et sans comparaison avec l'activité qu'exerce chacun des constituants de la composition séparément.

20 L'on donnera ci-après, à titre d'exemple non limitatif, un mode de préparation d'une composition conforme à la présente invention :

L'on réalise tout d'abord une émulsion de la solution de 17-valérate de bétaméthasone dans de l'huile d'olive vierge. Après homogénéisation, l'on incorpore successivement à l'émulsion la riboflavine sous la forme d'une solution à 0,50 % de vitamine B₂, puis l'amide nicotinique, sous la forme d'une solution à 5 % de vitamine PP. Après addition d'une essence aromatique en quantité suffisante, l'on procède à une dernière homogénéisation avant le conditionnement.

30 Un grand nombre d'observations cliniques ont été réalisées; toutes ont mis en évidence l'action très satisfaisante des compositions conformes à la présente invention, tant cosmétique que thérapeutique, sur la peau.

1ère observation :

35 Madame C.J., 32 ans, se présente, souffrant beaucoup d'un érythème solaire du troisième degré, avec petites formations bal-
leuses sur toutes les parties découvertes du corps, après une exposition d'une heure dans l'immobilité la plus complète ;
après une application d'une couche de la composition conforme
40 à l'invention, sur tout le corps, le Demandeur renvoie la patiente

5ème observation :

Monsieur H.Y., 60 ans, photosensibilisation tenace le la peau l'été, sous l'effet des rayons solaires, à la suite de l'absorption de "Médéril".

- 5 Le Demandeur fait arrêter la thérapeutique à base de "Médéril" et fait faire au patient des applications matin et soir de la composition conforme à l'invention.

Au bout d'une semaine de ce traitement, disparition totale de la photosensibilisation de la peau.

10 6ème observation :

Madame M.C., 33 ans, apparition de taches brunâtres frontales "post-abortionum".

- 15 Le Demandeur fait faire à la patiente des applications matin et soir, d'une très mince couche de la composition conforme à l'invention, en léger massage.

Au bout de trois semaines, disparition totale de la pigmentation inesthétique.

- 20 En ce qui concerne l'activité "bronzante", l'activité préventive vis-à-vis des rayons solaires et l'activité de traitement des érythèmes solaires, le Demandeur a procédé à un total de 300 observations, qui ont toutes abouti aux mêmes résultats exceptionnellement satisfaisants, sans aucune incidence sur l'état général ou local, si ce n'est, sur le plan local, à l'obtention recherchée de la pigmentation désirée (bronzage) avec une rapidité, 25 une homogénéité et une qualité esthétique excellentes.

- 30 Il résulte de la description qui précède que quels que soient les modes de mise en oeuvre, de réalisation et d'application adoptés, l'on obtient des compositions pour la prévention et le traitement des troubles dus à la photosensibilité de la peau qui présentent par rapport aux compositions visant au même but antérieurement connues, des avantages importants, et notamment une grande efficacité et une grande rapidité d'action.

- 35 Ainsi que cela ressort de ce qui précède, l'invention ne se limite nullement à ceux de ses modes de mise en oeuvre, de réalisation et d'application qui viennent d'être décrits de façon plus explicite dans ce qui précède ; elle en embrasse au contraire toutes les variantes qui peuvent venir à l'esprit du technicien en la matière, sans s'écarter du cadre ni de la portée de la présente invention.

RE V E N D I C A T I O N S

1 - Nouvelles compositions pour la prévention et le traitement des troubles dus à la photosensibilité de la peau, caractérisées en ce qu'elles sont constituées par l'association d'au moins une vitamine du groupe B, telle que riboflavine et/ou amide nicotinique, avec au moins un stéroïde possédant une action anti-inflammatoire et anti-allergique, tel qu'un dérivé d'hydrocortisone par exemple, dans un excipient permettant l'application locale desdites compositions en tant que topiques.

2 - Nouvelle composition selon la Revendication 1, caractérisée en ce qu'elle comprend les constituants actifs suivants :
Vitamines du groupe B : Riboflavine

Amide nicotinique

Stéroïde : 17-valérate de bétaméthasone

Excipient propre à permettre l'application locale de la composition en tant que topique.

3 - Nouvelles compositions thérapeutiques selon la Revendication 2, caractérisées par les teneurs suivantes en constituants actifs :

Vitamines du groupe B : Riboflavine	8,5 à 12 mg
Amide nicotinique	80 à 120 mg
Stéroïde : 17-valérate de bétaméthasone	150 à 250 mg
Excipient :	120 à 150 ml
Essence aromatique :	Q.S.

4 - Nouvelles compositions cosmétiques selon la Revendication 2, caractérisées par les teneurs suivantes en constituants actifs :

Vitamines du groupe B : Riboflavine	4 à 8 mg
Amide nicotinique	40 à 70 mg
Stéroïde : 17-valérate de bétaméthasone	80 à 120 mg
Excipient :	120 à 150 ml
Essence aromatique :	Q.S.

5- Nouvelles compositions pour la prévention et le traitement des troubles dus à la photosensibilité de la peau, selon l'une quelconque des Revendications 1 à 4, caractérisées en ce que l'excipient est choisi parmi les excipients propres à l'application desdites compositions en tant que topiques et compatibles avec les constituants actifs de la composition.